



(19)

(11) Publication number:

61221117

Generated Document.

PATENT ABSTRACTS OF JAPAN(21) Application number: **60063070**(51) Intl. Cl.: **A61K 9/48 A61J 3/07**(22) Application date: **26.03.85**

(30) Priority:

(43) Date of application
publication: **01.10.86**(84) Designated contracting
states:(71) Applicant: **FUJISAWA PHARMACEUT CO
LTD**(72) Inventor: **NISHIMURA KENICHI
MORIGAKI SATOSHI**

(74) Representative:

**(54) ENTERIC HARD
CAPSULE**

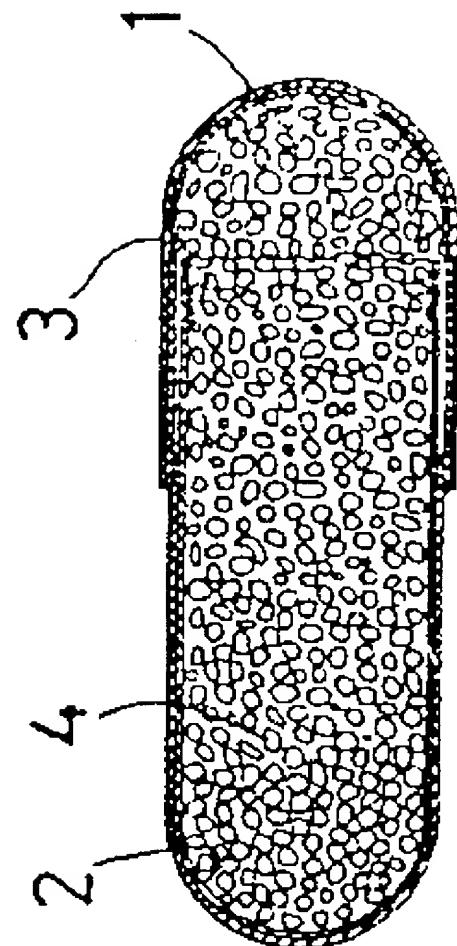
(57) Abstract:

PURPOSE: An enteric hard capsule that is produced by forming enteric films on the whole surface of the cap of the capsule, on the part which is overlapped with the cap and the body surface exposed without overlapping with the cap.

CONSTITUTION: An enteric hard capsule is composed of the cap 1 and the body 2 and is produced by forming enteric films 3 such as hydroxypropylmethylcellulose phthalate film on the whole surface of the cap 1 and the surface of the body parts which is overlapped with the cap 1 and exposed from the cap 1. In other words, prelocked capsules are coated with an enteric agent, filled with drugs 4 in a usual manner and locked to give capsules which can prevent gastric juice from coming through the overlapping part, because the part is coated with the enteric films.

BEST AVAILABLE COPY

COPYRIGHT: (C)1986,JPO&Japio



⑤日本国特許庁(JP)

⑥特許出願公開

⑦公開特許公報(A) 昭61-221117

⑧Int.Cl.¹A 61 K 9/48
A 61 J 3/07

識別記号

府内整理番号

⑨公開 昭和61年(1986)10月1日

6742-4C
7132-4C

審査請求 未請求 発明の数 2 (全3頁)

⑩発明の名称 腸溶性硬カプセル剤

⑪特 願 昭60-63070

⑫出 願 昭60(1985)3月26日

⑬発明者 西村 健一 高槻市城南町2-22-12

⑭発明者 森垣 聰 兵庫県多可郡八千代町中野間275-84

⑮出願人 藤沢薬品工業株式会社 大阪市東区道修町4丁目3番地

⑯代理人 弁理士 青木 高

明細書

1. 発明の名称

腸溶性硬カプセル剤

2. 特許請求の範囲

(1) キャップの全表面ならびに少なくともロック時にキャップと重複する部分およびキャップから露出する部分のボディ表面に腸溶剤の皮膜を形成させたキャップおよびボディからなる腸溶性硬カプセル。

(2) キャップの全表面ならびに少なくともロック時にキャップと重複する部分およびキャップから露出する部分のボディ表面に腸溶剤の皮膜を形成させたキャップおよびボディからなる腸溶性硬カプセルに医薬品等を充填し、キャップとボディとをロックしてなる腸溶性硬カプセル剤。

3. 発明の詳細な説明

【産業上の利用分野】

この発明は腸溶性硬カプセル剤に関するもので

あり、例えば医薬の分野で利用される。

【従来の技術】

腸溶性硬カプセル剤としては、カプセル内に医薬品を充填したのちカプセルの全表面に腸溶剤をコーティングしたもの、および腸溶剤で形成されたカプセルに医薬品を充填しコックしたのちキャップの下端部外周面を腸溶剤でシールしたものなどが知られている。

【発明が解決しようとする問題】

従来の腸溶性硬カプセル剤のうち、医薬品を充填したカプセルの全表面に腸溶剤をコーティングしたものでは、コーティング工程で生ずる不良品によるロスがカプセルだけにとどまらず、高価な医薬品のロスにもつながり、経済的な面で好ましくない。その上、医薬品の種類によっては、コーティング工程で溶や溶媒によりカプセル内に充填されている医薬品が変質するおそれもある。

また、腸溶剤で形成された硬カプセルは、従来のゼラチン硬カプセルより高価となり、未だ実用に供されていない。

48

この発明の発明者は、従来の崩壊性硬カプセル剤の有する上記のような欠点を解消すべく研究の結果、ブレロック状態のカプセルを崩壊剤でコーティングしたのち、常法により医薬品を充填し、ロックするだけで、意外なことに、ロック時にキャップと重複する部分のボディ表面に施された崩壊剤の皮膜がキャップとボディの嵌合部からの胃液の侵入を防止するのに充分なパッキング効果を発揮することを見出し、この発明を完成した。

【問題点を解決するための手段】

この発明はキャップの全表面ならびに少なくともロック時にキャップと重複する部分およびキャップから露出する部分のボディ表面に崩壊剤の皮膜を形成させたキャップおよびボディからなる崩壊性硬カプセル、およびこのようにしてなる崩壊性硬カプセルに医薬品等を充填し、キャップとボディとをロックしてなる崩壊性硬カプセル剤に関するものである。

したがって、この発明により提供されるものと

して、具体的には、キャップとボディの全表面に崩壊剤の皮膜をそれぞれ形成させたのちブレロック状態にした崩壊性硬カプセルおよびブレロック状態でカプセルの表面に崩壊剤の皮膜を形成させた崩壊性硬カプセル、ならびにこのようにして得られる崩壊性硬カプセルに医薬品等を充填したのちキャップとボディとをロックしてなる崩壊性硬カプセル剤などが含まれる。

この発明における硬カプセル自体としては、通常のゼチエンカプセルをそのまま使用することができ、これらのカプセルはいわゆるロック方式およびスナップフィット方式のいずれのものであってもよい。

崩壊剤としては、ヒドロキシプロピルメチルセルロース・フタレート、ヒドロキシプロピルメチルセルロース・アセナルサクシネット、酢酸フルカルセルロース、メタアクリル酸・メタアクリル酸メチル・コポリマーなど通常の崩壊剤が使用され得る。

崩壊剤の皮膜の形成は、回転パン中のカプセル

に崩壊剤含有液波を加温下に吸着する、通常のフィルムコーティング法により行うことができる。

カプセル表面に形成される皮膜の厚さは、キャップとボディの嵌合部からの水分の侵入を防止できる程度であればよく、特に限定されないが、通常、80μm程度で充分である。

【実施例】

ブレロック状態のカプセル表面に崩壊剤の皮膜を形成させた場合について、以下に説明する。

実施例

コーティング液の处方：

HP-55本	8.1 重量部
トリアセチン	0.9 重量部
エタノール	45.5 重量部
ジクロルメタン	45.5 重量部

コーティングパン(ハイコーダミニ、フロイント産業株式会社製)にブレロック状態(第1図(A)参照)の1号カプセル1500個を入れ、パンを回転(20 rpm)させながら、上記組成のコーティング液をスプレーガン(口径1.5mm)か

ら1.0ml/分の割合で連続噴霧した。噴霧中の吸気温度は40°C、排気温度は25~30°C、スプレー空気圧は1.0kPa/cm²であった。

このようにして、崩壊剤の皮膜量が1カプセル当たりそれぞれ1.0mg、1.4mg、1.8mgおよび3.8mgのカプセルを得た【第1図(B)参照】。

これらのカプセルのキャップとボディを離し【第1図(C)参照】、常法により、医薬品の粉末を充填し、ロックして崩壊性硬カプセル剤を得た【第1図(D)参照】。

(*HP-55: 信越化学工業株式会社製のヒドロキシプロピルメチルセルロース・フタレート)

試験例

上記の実施例で得られた崩壊性硬カプセル剤および無処理の硬カプセル剤(対照)を用いて(1群6カプセル)、第10改正日本薬局方に規定されている崩壊性製剤の崩壊試験法に準じて崩壊試験を行なった。なお、第1液、第2液とも液温は

37°Cとし、第1液試験、第2液試験ともジスクを用いた。

試験結果(崩壊時間)を次表に示す。

試験液	皮膜量					
		0mg/cap	10mg/cap	14mg/cap	18mg/cap	38mg/cap
第1液	1~3分	90~115分 (2cap)	120分で 変化なし	同左	同左	
		120分で 変化なし (4cap)				
第2液	—	—	1.9~3.5分	2.7~4.2分	5.0~8.5分	

上記の試験結果から明らかのように、崩壊液の皮膜量が1カプセル当たり14mg以上であるものが崩壊性製剤としての規格に適合した。

しかしながら、皮膜量が1カプセル当たり38mgのカプセルでは、皮膜がやや厚すぎて医薬品充填後のカプセルのロックに支障を来たすおそれがある。

したがって、1カプセル当たりの皮膜量が18mg前後のものが好ましいと判定した。このカプセルの皮膜の厚さは約80μmであった。

【発明の効果】

この発明の崩壊性硬カプセル剤は、プレロック状態のカプセル表面に崩壊剤の皮膜を施しただけで崩壊性製剤の試験規格に適合し、崩壊性硬カプセル剤の生産コストの低減というすぐれた効果を有する。

4. 図面の簡単な説明

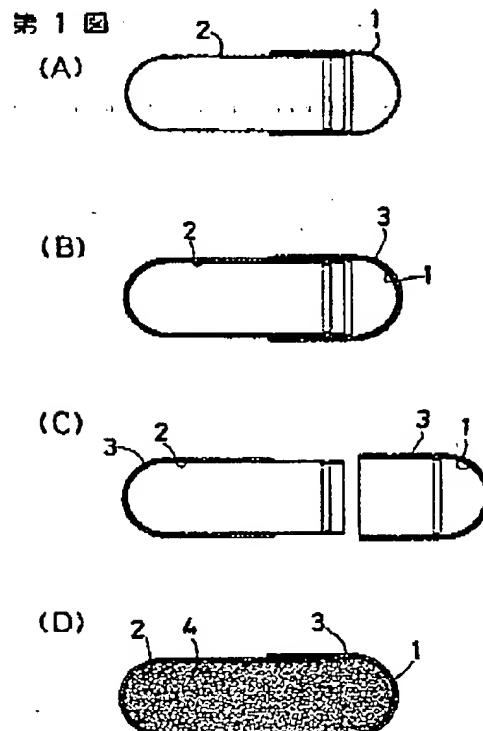
第1図はこの発明の崩壊性硬カプセル剤の製造過程を示す断面図であり、(A)は皮膜形成前

のプレロック状態、(B)は皮膜形成後のプレロック状態、(C)はキャップとボディを離した状態、そして(D)は医薬品充填後のロック状態をそれぞれ示す。

1---キャップ、2---ボディ、
3---崩壊剤の皮膜、4---医薬品

特許出願人 藤沢薬品工業株式会社

代理人 弁理士 青木 高 (公印)



**This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning
Operations and is not part of the Official Record**

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

BLACK BORDERS

IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES

FADED TEXT OR DRAWING

BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING

SKEWED/SLANTED IMAGES

COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS

GRAY SCALE DOCUMENTS

LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT

REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY

OTHER: _____

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.